



(18)

REPÚBLICA FEDERATIVA DO BRASIL  
Ministério da Indústria e do Comércio  
Instituto Nacional da Propriedade Industrial



<b>(12) PEDIDO DE PRIVILÉGIO</b>	<b>A</b>	<b>(11) (21) Número: PI</b> 8803621 <b>(22) Data do depósito:</b> 19.07.88
<b>(30) Prioridade unionista:</b> (31) 2747/87 (32) 20.07.87 (33) CH	<b>(51) Int. CL</b> 4 A 01 N 47/40	
<b>(43) Data da publicação do pedido:</b> (RPI ) 08.02.89 (RPI 955) <b>(46) Data da Publicação das reivindicações</b>	<b>(54) Título:</b> Emprego de um composto, composição e processo para o combate de insetos.	
<b>(71) Depositante:</b> Ciba-Geigy Ag. (CH)  <b>(72) Inventor(es):</b> Dr. Laurenz Gsell  <b>(74) Procurador:</b> Dannemann, Siemsen, Bigler & Ipanema Moreira	<b>(80) Pedido Depositado via PCT - Referências:</b> <b>(85) Data do início da fase nacional:</b> <b>(88) Pedido Internacional</b>  <b>(87) Publicação Internacional:</b>  <b>(81) Países designados:</b> <b>(82) Países eleitos:</b> Comunicado pela RPI nº                      de	
<b>(23) Complementação da Garantia de Prioridade</b> Data:	<b>(82) Desdobramento (origem)</b> Nº                      Data:	
<b>(67) Resumo:</b>		

Relatório Descritivo da Patente de Invenção pa-  
 ra "EMPREGO DE UM COMPOSTO, COMPOSIÇÃO E PROCESSO PARA O  
 COMBATE DE INSETOS".

A presente invenção refere-se ao emprego de de  
 5 terminados derivados de N-picolil-N'-ciano-guanidina pa-  
 ra o combate de pragas, bem como a composições praguici-  
 das que contêm esses compostos como componentes pestici-  
 das.

O objeto da invenção é o emprego de um composto  
 10 da fórmula I e seus tautômeros



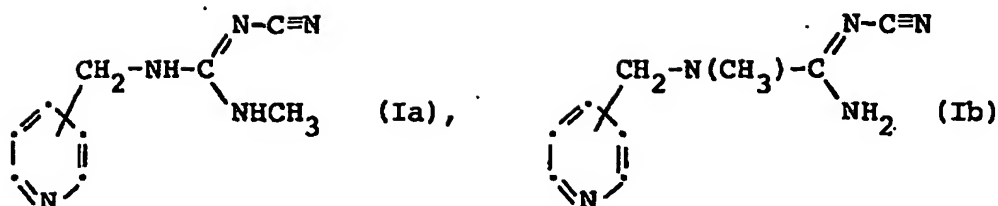
em que A é um radical



para o combate de insetos prejudiciais e pragas da ordem  
 acarina.

De preferência empregam-se, de acordo com a in-  
 15 venção, os compostos das fórmulas Ia e Ib:

380301

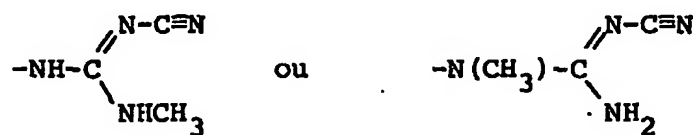


No contexto do emprego proposto da invenção preferem-se especialmente aqueles compostos das fórmulas I, Ia e Ib, em que o radical piridila é um radical pirid-3-ila.

5 Um outro objeto da presente invenção são novas composições para o combate de insetos prejudiciais e pragas da ordem acarina, contendo além dos diluentes, agentes auxiliares e aditivos usuais como componentes ativos, pelo menos um composto da fórmula I ou seus tautômeros



10 em que A é um radical



N-picolil-N-metil-N'-ciano-guanidinas, que se encontram no contexto da fórmula I acima, sua preparação e seu emprego como produtos intermediários para a síntese de farmacêuticos já foram descritos na patente norte-americana nº 3.147.271. A preparação de N-picolil-N-metil-N'-ciano-guanidinas de eficiência farmacêutica é ci-

tada também em C.A. Volume: 90, (1979) 90:87289 f.

Foi agora surpreendentemente comprovado que os compostos citados da fórmula I apresentam, com boa compatibilidade às plantas e pequena toxicidade aos animais de sangue quente, também excelente eficiência como composições praguicidas. Eles se prestam sobretudo para o combate de pragas que infestam plantas e animais. Nesse contexto, salienta-se a pequena toxicidade a peixes dos compostos da invenção.

10 Especialmente se prestam os compostos da fórmula I para o combate de insetos das ordens Lepidoptera, Coleoptera, Homoptera, Heteroptera, Diptera, Thysanoptera, Orthoptera, Anoplura, Hyphonaptera, Mallophaga, Thysanura, Isoptera, Psicoptera e Hymenoptera e de representantes da ordem Acarina, especialmente ácaros e carrapatos.

O bom efeito pesticida dos compostos da invenção corresponde a uma taxa de eliminação (mortalidade) de pelo menos 50-60% das pragas citadas.

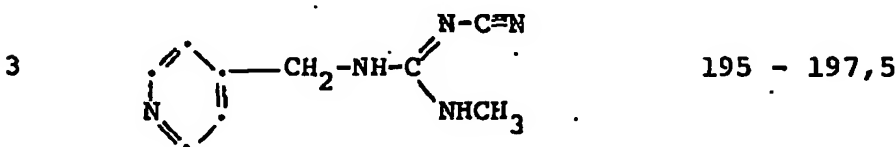
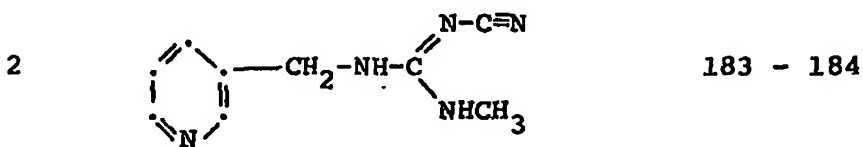
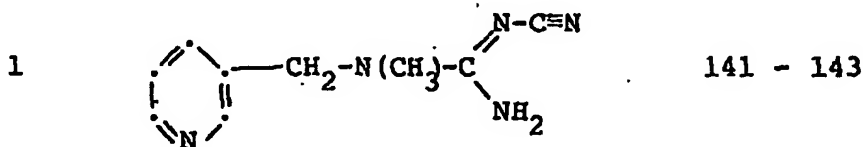
20 Além de seu efeito em relação a moscas e mosquitos, como por exemplo *Aedes aegypti* e *Musca domestica*, os compostos da fórmula I podem ser empregados também para combate de insetos devoradores prejudiciais às plantas em plantações ornamentais e úteis, como em culturas de algodão (por exemplo contra *Spodoptera littoralis* e *Heliothis virescens*) bem como em culturas de cereais, frutas e verduras (por exemplo contra *Laspeyresia pomonella*, *Leptinotarsa decemlineata* e *Epilachna varivestis*).

Os compostos da fórmula I se salientam também por bom efeito contra estágios de insetos larvais e ninfas, especialmente de insetos prejudiciais devoradores. Sobre-  
do podem ser empregados os compostos da fórmula I com su-  
5 cesso excelente contra cigarras prejudiciais às plantas, especialmente em culturas de arroz. Cita-se especialmen-  
te neste contexto a favorável toxicidade aos peixes dos compostos da fórmula I. Além disso, deve-se salientar que os compostos da fórmula I se destacam tanto por um  
10 forte efeito sistêmico como também por efeito de contato contra insetos sugadores, como insetos da família Aphidi-  
dae (como por exemplo Aphis fabae, Aphis craccivora, Aoni-  
diella aurantii e Myzus persicae).

Especialmente apropriados para as finalidades  
15 da invenção são os seguintes compostos, que caem no con-  
texto da fórmula I, a partir das publicações conhecidas acima citadas:

Composto Nº

p.f. [°C]



O efeito dos compostos a serem empregados da invenção ou das composições contendo os mesmos pode ser essencialmente ampliado por adição de outros inseticidas e/ou acaricidas e adequado às condições dadas. Como aditivos entram em consideração por exemplo representantes das seguintes classes de substância ativa: compostos de fósforo orgânicos, nitrofenóis e derivados, formamidas, uréias, carbamatos, piretróides, hidrocarbonetos clorados e preparados de *Bacillus thuringiensis*.

Os compostos da fórmula I são empregados em forma não modificada ou, de preferência, juntamente com os agentes auxiliares usuais na técnica de formulação e são elaborados de modo conhecido por exemplo para darem concentrados em emulsão, soluções diretamente pulverizáveis ou diluíveis, emulsões diluídas, pós de pulverização, pós solúveis, agentes de polvilhamento, granulados, também encapsulamentos em por exemplo substâncias polímeras. Os processos de emprego, como pulverização, nebulização, polvilhamento, difusão ou rega são escolhidos, da mesma forma como as composições, adequando-se aos alvos desejados e às proporções dadas.

A formulação, ou seja, as composições contendo a substância ativa, ou combinações dessas substâncias ativas com outros inseticidas ou acaricidas, e eventualmente um aditivo sólido ou líquido, as preparações ou as combinações, são preparadas de modo conhecido, por exemplo por mistura íntima e/ou moagem das substâncias ativas com agentes distensores, como por exemplo com sol-

ventes, veículos sólidos e compostos eventualmente tenso-  
ativos (tensídios).

Como solventes entram em consideração: hidrocar-  
bonetos aromáticos, de preferência as frações  $C_8$  a  $C_{12}$ ,  
5 como por exemplo misturas de xileno ou naftalenos substi-  
tuídos, ésteres de ácido ftálico, como dibutil- ou dioctil  
ftalato, hidrocarbonetos alifáticos, como ciclohexano,  
parafinas, álcoois e glicóis e seus éteres e ésteres, co-  
mo etanol, etilenoglicol, etilenoglicolmonometil- ou -e-  
10 tiléter, cetonas, como ciclohexanona, solventes fortemen-  
te polares, como N-metil-2-pirrolidona, dimetilsulfóxido  
ou dimetilformamida e óleos vegetais epoxidados eventual-  
mente, como óleo de coco epoxidado ou óleo de soja, ou  
água.

15 Como veículos sólidos, por exemplo para agentes  
de polvilhamento e pós dispersáveis, empregam-se na regra  
farinhas minerais naturais, como calcita, talco, caulim,  
montmorilonita ou atapulgita. Para melhora das proprie-  
dades físicas pode-se adicionar também ácido silícico al-  
20 tamente disperso ou polímeros capazes de sucção altamen-  
te dispersos. Como veículos de granulado adsorçivos, em  
grãos, entram em consideração tipos porosos, como por e-  
xemplo pedra-pomes, pedaços de telha, sepiolita ou bento-  
nita, como materiais de suporte não sorcivos, por exem-  
25 plo calcita ou areia. Pode-se empregar um grande número  
de materiais granulados, de natureza orgânica ou inorgâ-  
nica, como especialmente dolomita ou resíduos vegetais  
triturados.

Como compostos tensoativos entram em consideração, dependendo do tipo da substância ativa a ser formulada da fórmula I ou das combinações dessas substâncias ativas com outros inseticidas ou acaricidas, tensoativos não iônicos, cátion-ativos e/ou ânion-ativos com boas propriedades de emulscionamento, dispersão e umectação. Por tensoativos entendem-se também misturas de tensoativos.

Tensoativos aniônicos apropriados podem ser tanto os chamados sabões hidrossolúveis como também compostos tensoativos sintéticos hidrossolúveis.

Como sabões se prestam os sais alcalinos, sais alcalino-terrosos ou sais de amônio eventualmente substituídos de ácidos graxos superiores ( $C_{10}$ - $C_{22}$ ), como por exemplo os sais de sódio ou de potássio do ácido oléico ou esteárico, ou de misturas de ácidos graxos naturais, que podem ser obtidas por exemplo de óleo de coco ou óleo de tál. Além disso, citam-se como tensoativos também os sais de metil-aurina de ácidos graxos bem como fosfolipídios modificados e não modificados.

Muitas vezes, contudo, empregam-se os chamados tensoativos sintéticos, especialmente sulfonatos graxos, sulfatos graxos, derivados sulfonados de benzimidazol ou alquilarilsulfonatos.

Os sulfonatos ou sulfatos graxos se encontram, na regra, como sais alcalinos, alcalino-terrosos ou sais de amônio eventualmente substituídos e apresentam, em geral, um radical alquila com 8 a 22 átomos de carbono, sen



do que alquila inclui também a parte alquílica de radicais acila, por exemplo o sal de sódio ou de cálcio do ácido ligninossulfônico, do éster do ácido dodecilsulfúrico ou de uma mistura de sulfato de álcool graxo preparada de ácidos graxos naturais. A estes pertencem também os sais de ésteres de ácido sulfúrico e ácido sulfônico de produtos de adição de óxidos de etileno e álcool graxo. Os derivados sulfonados de benzimidazol contêm, de preferência, 2 grupos de ácido sulfônico e um radical de ácido graxo com cerca de 8-22 átomos de carbono. Alquil arilsulfonatos são por exemplo sais de Na, Ca ou trietanolamina de ácido dodecilbenzenossulfônico, ácido dibutil naftalenossulfônico ou um produto de condensação de formaldeído e ácido naftalenossulfônico. Além disso, entram em consideração também os correspondentes fosfatos, como por exemplo sais do éster de ácido fosfórico de um produto de adição de óxido de etileno-(4-14)-p-nonilfenol.

Como tensoativos não iônicos entram em consideração, em primeira linha, derivados de poliglicoléter de álcoois alifáticos ou cicloalifáticos, ácidos graxos saturados ou insaturados e alquilfenóis, que podem conter 3 a 30 grupos de glicoléter e 8 a 20 átomos de carbono no radical hidrocarboneto (alifático) e 6 a 18 átomos de carbono no radical alquila dos alquilfenóis. Além disso, tensoativos não iônicos apropriados são os produtos de adição de óxido de polietileno hidrossolúveis, contendo 20 a 250 grupos de etilenoglicoléter e 10 a 100 grupos de propilenoglicoléter em polipropilenoglicol, etilenodia

minopolipropilenoglicol e alquilpolipropilenoglicol com 1 a 10 átomos de carbono na cadeia alquílica. Os compostos citados contêm usualmente, por unidade de propilenoglicol, 1 a 5 unidades de etilenoglicol.

5           Como exemplos de tensoativos não iônicos citam-se nonilfenolpolietoxietanóis, poliglicolêter de óleo de rícino, aduto de óxido de polietileno-polipropileno, tributilfenoxipolietoxietanol, polietilenoglicol e octilfenoxipolietoxietanol. Além disso, entram em consideração  
10 também ésteres de ácidos graxos de polioxietilenossorbitano como o trioleato de polioxietilenossorbitano.

          Por tensoativos catiônicos trata-se sobretudo de sais de amônio quaternários, que contêm como N-substituintes pelo menos um radical alquila com 8 a 22 átomos  
15 de carbono e apresentam, como outros substituintes, radicais alquila inferiores, eventualmente halogenados, radicais benzila ou radicais hidroxialquila inferiores. Esses sais se encontram, de preferência, como halogenetos, metilsulfatos ou etilsulfatos, por exemplo cloreto de este  
20 ariltrimetilamônio ou brometo de benzil-di-(2-cloroetil)-etilamônio.

Os tensoativos usados na técnica de formulação estão descritos, entre outros, nas seguintes publicações:

25           "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual".

MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey,  
1979;

Dr. Helmut Stache "Tensid Taschenbuch", Editio-

ra

Carl Hanser, Munique/Viena 1981.

As preparações pesticidas da invenção contêm -  
relativo ao peso - na regra 0,1 a 99%, especialmente 0,1  
5 a 95% de uma substância ativa da fórmula I ou combinações  
destas com outros inseticidas ou acaricidas, 1 a 99,9% de  
um aditivo sólido ou líquido e 0 a 25%, especialmente 0,1  
a 20% de um tensoativo. Enquanto como mercadoria comer-  
cial são preferidas composições concentradas, o usuário  
10 final emprega na regra preparações diluídas, que apresen-  
tam concentrações essencialmente menores de substância a-  
tiva; por exemplo 0,1 a 1.000 ppm.

As composições pesticidas podem conter também  
outros aditivos como estabilizadores, desespumadores, re-  
15 guladores de viscosidade, aglutinantes, aderentes e fer-  
tilizantes ou outras substâncias ativas para a produção  
de efeitos especiais.

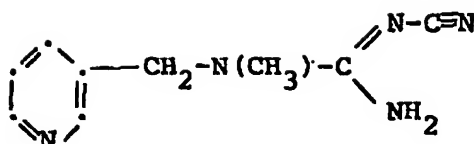
Exemplo 1: Preparação de N- $\beta$ -picolil-N-metil-N'-ciano-  
guanidina

20 Aplicam-se 7,3 g de dimetil-N-ciano-tioiminocar-  
bonato de 6,1 g de  $\beta$ -picolil-metilamina em 20 ml de eta-  
nol. Na preparação introduz-se durante uma hora NH<sub>3</sub> ga-  
soso, sendo que ocorre uma reação exotérmica (até 35°C).  
Agita-se posteriormente por mais uma hora. O metilmercâp  
25 tan formado é retirado completamente por sopragem de gás  
N<sub>2</sub>. O solvente é destilado e o produto é cristalizado  
por adição de éter.

Dessa forma obtém-se o composto do título da

3800601

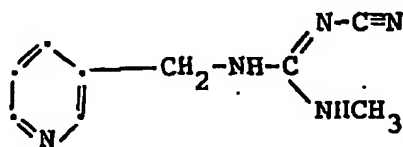
fórmula



com um ponto de fusão de 141 - 143°C (composto nº 1).

Exemplo 2: Preparação de N-β-picolil-N'-metil-N"-ciano-  
-guanidina

5 Mantêm-se em refluxo durante 2 horas, 5,4 g de  
3-picolilamina, 7,31 g de dimetil-N-cianotioiminocarbona  
to e 50 mg de dimetilaminopiridina (como catalisador) em  
50 ml de acetonitrila. A preparação é esfriada posteri-  
10 rmente a 5°C, filtram-se por sucção os cristais forma-  
dos e lava-se com éter. Dessa forma obtêm-se N-ciano-5-  
-metil-N'-β-picolil-isotiourêia (ponto de fusão 152-  
154°C). Desse composto, mantêm-se em refluxo durante 16  
horas, 62 g juntamente com 3 g de metilamina a 40% (em  
álcool) e 50 ml de álcool. Após resfriamento em uma mis-  
15 tura de gelo/cloreto de sódio se separa o composto do tí-  
tulo da fórmula



em forma de cristais, que são filtrados por sucção e pos-  
suem um ponto de fusão de 183-184°C (composto nº 2).

Exemplo 3: Formulações para Substâncias Ativas da fórmula

(% = por cento em peso)

<u>1. Pó de Pulverização</u>		a)	b)	c)
Substância ativa segundo exemplos de preparação		20%	50%	75%
5	Ligninossulfonato de Na	5%	5%	-
	Laurilsulafato de Na	3%	-	5%
	Diisobutilnaftalenossulfonato de Na	-	6%	10%
	Octilfenolpolietilenoglicoléter (7-8 moles de OE)	-	2%	-
10	Ácido silícico altamente disperso	5%	10%	10%
	Caulim	67%	27%	-

A substância ativa é bem misturada com os aditivos e bem moída em um moinho apropriado. Obtêm-se pós de pulverização, que podem ser diluídos com água para dar 15 rem suspensões em qualquer concentração desejada.

<u>2. Concentrado em emulsão</u>		a)	b)
Substância ativa segundo exemplos de preparação		10%	10%
	Octilfenolpolietilenoglicoléter (4-5 moles de OE)	3%	-
20	Dodecílbenzenossulfonato de Ca	3%	-
	Poliglicoléter de óleo de rícino (36 moles de OE)	4%	-
	Tioxilato de óleo de rícino	-	25%
25	Ciclohexanona	30%	-
	Butanol	-	15%
	Mistura de xileno	50%	-
	Éster acético	-	50%

Desse concentrado podem-se preparar, por diluição com água, emulsões em qualquer concentração desejada.

3. Agente de Polvilhamento

	a)	b)
Substância ativa segundo exemplos		
5 de preparação	5%	8%
Talco	95%	-
Caulim	-	92%

Obtêm-se agentes de polvilhamento prontos para uso, quando se mistura a substância ativa com o veículo e se mói em um moinho apropriado.

4. Granulado extrudado

Substância ativa segundo exemplos	
de preparação	10%
Ligninossulfonato de Na	2%
15 Carboximetilcelulose	1%
Caulim	87%

A substância ativa é misturada com os aditivos, moída e umidificada com água. Essa mistura é extrudada e posteriormente seca em corrente de ar.

20 5. Granulado de envolvimento

Substância ativa segundo exemplos	
de preparação	3%
Poli-etilenoglicol (PM 200)	3%
Caulim	94%

25 A substância ativa finamente moída é aplicada uniformemente em um misturador sobre o caulim umidificado com poli-etilenoglicol. Dessa forma, obtêm-se granulos de envolvimento isentos de poeira.

6. Concentrado em Suspensão

Substância ativa segundo exemplos de

preparação 40%

Etilenoglicol 10%

5 Nonilfenolpolietilenoglicolêter (15

moles de OE) 6%

Ligninossulfonato de Na 10%

Carboximetilcelulose 1%

Solução a 37% aquosa de formaldeído 0,2%

10 Óleo de silicone na forma de uma emul-

são a 75% aquosa 0,8%

Água 32%

A substância ativa finamente moída é misturada intimamente com os aditivos. Obtém-se assim um concen-  
15 trado em suspensão, do qual por diluição com água podem-se preparar suspensões em qualquer concentração desejada.

Exemplo 4: Efeito contra Lucilia sericata

Adiciona-se a 9 ml de um meio de cultura a 50°C, uma preparação aquosa contendo 0,1% de substância ativa.

20 Adicionam-se cerca de 30 larvas recentemente saídas dos ovos de Lucilia sericata ao meio de cultura.. Após 48 e 96 horas, constata-se o efeito inseticida por determinação da taxa de eliminação.

Compostos da fórmula I mostram nesse teste bom  
25 efeito (mortalidade) contra Lucilia sericata.

Exemplo 5: Efeito contra Aedes aegypti

Sobre a superfície de 150 ml de água, que se en-  
contra em um recipiente, pipeta-se tanto de uma solução

acetônica a 0,1% da substância ativa, que se obtém uma concentração de 400 ppm. Após volatilização da acetona, alimenta-se o recipiente com 30 a 40 larvas de Aêdes de 2 dias. Após 2 e 7 dias, testa-se a percentagem de mortalidade (número de larvas capazes de sobrenadarem).

Compostos da fórmula I mostram bom efeito (mortalidade) no teste acima.

Exemplo 6: Efeito de Contato Inseticida: Aphis craccivora

Plantas crescidas em vasos (Vicia faba) são infestadas, antes do início da experiência, cada uma com cerca de 200 indivíduos da espécie Aphis craccivora. As plantas assim tratadas são pulverizadas 24 horas mais tarde com uma preparação aquosa contendo 400 ppm do composto a ser testado, até gotejamento. Empregam-se, por composto de teste, duas plantas e efetua-se uma avaliação da taxa de eliminação produzida após mais 24 horas.

Compostos da fórmula I mostram boa eficiência (mortalidade) nesse teste.

Exemplo 7: Efeito Sistêmico Inseticida: Aphis craccivora (Terra)

Plantas de feijão enraizadas são transplantadas para vasos, que contêm 600 cm<sup>3</sup> de terra. Posteriormente regam-se 50 ml de uma preparação dos compostos a serem testados (obtidos de um pó de pulverização a 25%) em uma concentração de 400 ppm diretamente sobre a terra nos vasos.

Após 24 horas, colocam-se sobre as partes de



planta acima da terra piolhos da espécie *Aphis craccivora* e cobrem-se as plantas com um cilindro de plástico para proteger os piolhos de um eventual efeito de contato ou de gás da substância de teste.

5                   A avaliação da mortalidade produzida efetua-se 48 a 72 horas após o início da experiência. Por substância de teste empregam-se duas plantas, cada uma em um vaso separado. A experiência é efetuada a 25°C e a 70% de umidade relativa do ar.

10                   Os compostos da fórmula I mostram bom efeito no teste acima.

Exemplo 8: Efeito Inseticida de Contato: *Myzus persicae*

Estacas de ervilha crescidas em água, com cerca de 4 cm de altura, são infestadas antes do início da experiência, cada uma com cerca de 200 indivíduos da espécie *Myzus persicae*. As plantas assim tratadas são pulverizadas 24 horas mais tarde com uma suspensão aquosa contendo 400 ppm do composto a ser testado, até gotejamento. Empregam-se, por preparação, duas plantas. Uma avaliação da taxa de eliminação produzida efetua-se 48 horas após aplicação. A experiência é efetuada a 20-22°C e a 60% de umidade relativa do ar.

Os compostos da fórmula I mostram bom efeito no teste acima.

25 Exemplo 9: Efeito Sistêmico Inseticida: *Myzus persicae*

Plantas de couve enraizadas no estágio de 4 a 5 folhas são transplantadas para vasos, que contêm 60 cm<sup>3</sup> de terra. Posteriormente regam-se diretamente sobre a

terra 50 ml de uma formulação aquosa do composto I a ser testado (obtido de um pó de pulverização a 25%) em uma concentração de 400 ppm.

Após 24 horas colocam-se piolhos de folha sobre as partes de planta acima da terra das plantas tratadas da espécie *Myzus persicae* e cobrem-se as plantas com cilindros de plástico, para proteger os piolhos de folha de um eventual efeito de contato ou de gás da substância de teste.

A avaliação da percentagem de eliminação produzida efetua-se 48 horas após o início da experiência. Por substância de teste, empregam-se duas plantas, cada uma em vasos separados. A experiência é efetuada a cerca de 25°C e a 60% de umidade relativa do ar.

Os compostos da fórmula I mostram bom efeito no teste acima.

Exemplo 10: Efeito Inseticida de Penetração da Folha: *Aphis craccivora*

Em recipientes de plástico com cerca de 8 cm de altura (diâmetro de cerca de 6 cm) coloca-se um pequeno galho de *Vicia faba*, que foi fortemente infestado com piolhos de folha da espécie *Aphis craccivora*. O recipiente é coberto com uma tampa de plástico, que apresenta no meio uma abertura de 2 cm de diâmetro. Na abertura que se encontra na tampa coloca-se uma folha de uma planta de *Vicia faba*, sem separar essa folha da planta enraizada. A folha é então fixada com uma segunda tampa de furo sobre o recipiente acima da abertura da primeira

tampa. Do lado inferior, ou seja, através da abertura da primeira tampa, os piolhos de folha que se encontram no recipiente infestam a folha que se encontra superiormente da planta de ração. No lado superior coloca-se uniformemente sobre a folha uma preparação aquosa da substância ativa a ser testada em uma concentração de 400 ppm por meio de um pincel. É testado se a substância de teste aplicada em um lado da parte superior da folha da planta de ração foi difundida em quantidade suficiente pela folha em sua parte inferior, a fim de ali matar os piolhos de folha sugadores.

A experiência é efetuada a cerca de 20°C e a 60% de umidade relativa do ar. A avaliação sobre a percentagem de mortalidade efetua-se 48 horas após aplicação de substância ativa.

Compostos da fórmula I mostram bom efeito no teste acima.

Exemplo 11: Efeito Inseticida (Sistêmico-Água): Aphis craccivora

Estacas de ervilhas, que foram infestadas 24 horas antes do início da experiência com os piolhos de folha, são colocadas em 20 ml de um caldo aquoso, que contém 400 ppm da substância ativa a ser testada. O caldo aquoso é preparado de um concentrado em emulsão ou de uma preparação em pó umectável da substância ativa correspondente e se acha em um recipiente, que é fechado com uma tampa de plástico que apresenta um furo. A raiz das plantas de ervilha infestadas é empurrada através de um

furo na tampa de plástico para o caldo. O furo é então tampado com algodão, para fixar as plantas e eliminar uma eventual influência da fase gasosa do caldo.

A experiência é efetuada a 20°C e a 60% de umidade relativa do ar. Após dois dias avalia-se o número de animais de teste não mais capazes de sucção em comparação com o controle não tratado. Constata-se assim se a substância ativa absorvida pelas raízes matou os pulgões de folha na parte superior das plantas.

Compostos da fórmula I mostram na experiência acima um bom efeito sistêmico contra insetos da espécie *Aphis craccivora*.

Exemplo 12: Efeito de Contato e de Envenenamento por Devorção sobre *Laodelphax striatellus* e *Nilaparvata lugens* (Ninfas)

O teste é efetuado em plantas que crescem. Para isto, plantam-se 4 plantas de arroz (espessura da haste 8 mm) com uma altura de cerca de 20 cm em vaso (diâmetro de 8 cm).

As plantas são pulverizadas em um prato rotativo com 100 ml de uma solução acetônica contendo 100 ppm da substância ativa correspondente. Após a secagem da preparação de pulverização, efetua-se a infestação de cada planta com 20 ninfas dos animais de teste no terceiro estágio. Para evitar a fuga das cigarras, coloca-se sobre as plantas infestadas um cilindro de vidro aberto em ambos os lados e tampa-se esse com uma tampa de gaze. As ninfas são mantidas nas plantas tratadas até se alcançar

o estágio subsequente de desenvolvimento após 10 dias. A avaliação sobre a percentagem de mortalidade efetua-se 1, 4 e 8 dias após o tratamento.

Os compostos n<sup>os</sup>. 1 e 2 mostram 80-100% de efeito nesse teste contra *Nilaparvata lugens*.

Exemplo 13: Efeito Sistêmico sobre *Nilaparvata lugens*

Plantas de arroz com cerca de 10 dias de idade (cerca de 10 cm de altura) são colocadas em um recipiente de plástico, que contém 20 ml de uma preparação em emulsão aquosa da substância ativa a ser testada em uma concentração de 100 ppm e que é fechado com uma tampa de plástico apresentando um furo. A raiz das plantas de arroz é empurrada através de um furo na tampa de plástico para a preparação de teste aquosa. O furo foi então tampado com algodão, para fixar as plantas e excluir a influência da fase gasosa da preparação de teste. Infestam-se então as plantas de arroz com 20 ninfas de *Nilaparvata lugens* no estágio N 2 a N 3 e tampa-se com um cilindro de plástico. A experiência é efetuada a 20°C e a 60% de umidade relativa do ar em um período de exposição à luz de 16 horas. Após cinco dias, avalia-se sobre o número dos animais de teste mortos, em comparação com o controle não tratado. Assim, é constatado se a substância ativa absorvida pela raiz matou os animais de teste nas partes superiores das plantas.

Os compostos n<sup>os</sup>. 1, 2 e 3 mostram no teste acima, 80-100% de efeito (mortalidade) contra *Nilaparvata lugens*.

Exemplo 14: Efeito Inseticida de Contato e de Envenenamento por Devoração

Plantas de algodão em vasos com cerca de 25 cm de altura são pulverizadas com emulsões de substância ativa aquosas, que contêm a substância ativa em uma concentração de 800 ppm.

Após a secagem da preparação de pulverização, infestam-se as plantas de algodão com larvas de *Spodoptera littoralis* ou *Heliothis virescens* no primeiro estágio larval. A experiência é efetuada a 24°C e a cerca de 60% de umidade relativa do ar. Após 120 horas, determina-se a percentagem de mortalidade dos insetos de teste em relação ao controle não tratado.

Compostos da fórmula I mostram bom efeito (mortalidade) contra larvas de *Spodoptera* nesse teste.

Exemplo 15: Efeito contra *Nephotettix cincticeps* (ninfas)

O teste é efetuado em plantas que crescem. Para isto, plantam-se plantas de arroz com cerca de 20 dias de idade com uma altura de cerca de 15 cm em vasos (diâmetro 5,5 cm).

As plantas são pulverizadas em um prato rotativo com 100 ml de uma solução acetônica contendo 400 ppm da substância ativa a ser testada. Após a secagem da preparação de pulverização, efetua-se a infestação de cada planta com 20 ninfas dos animais de teste no segundo ou terceiro estágio. Para se impedir a fuga das cigarras, coloca-se sobre as plantas infestadas um cilindro de "plexiglas" e cobre-se esse com uma tampa de gaze. As

2803521

ninfas são mantidas por 5 dias nas plantas tratadas, que devem ser pelo menos uma vez regadas. A experiência é efetuada a uma temperatura de cerca de 23°C, a 55% de umidade relativa do ar e com um período de iluminação de 16 5 horas.

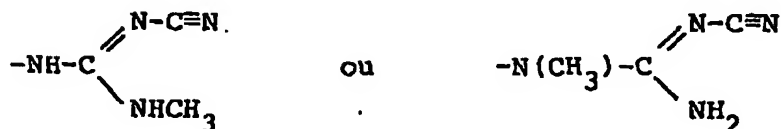
Compostos da fórmula I mostram nesse teste bom efeito.

REIVINDICAÇÕES

1. - Emprego de um composto da fórmula I e seus tautômeros

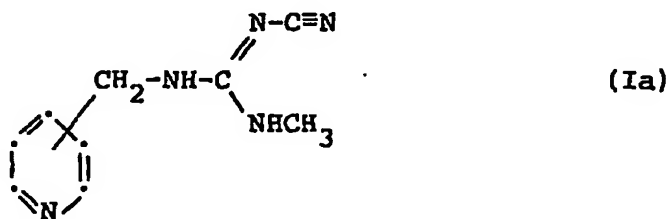


em que A é um radical



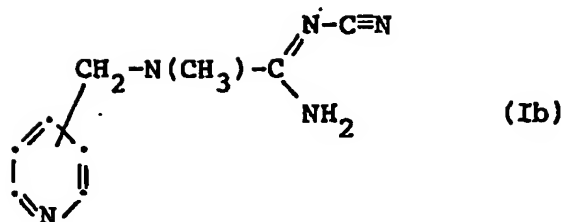
5 caracterizado pelo fato de ser para o combate de insetos prejudiciais e pragas da ordem acarina.

2. - Emprego segundo a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de ser de um composto da fórmula Ia



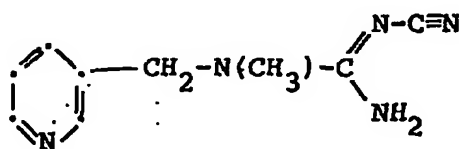
3. - Emprego segundo a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de ser de um composto da fórmula Ib



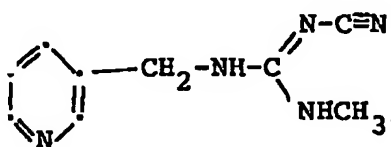


4. - Emprego segundo uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de ser de um composto da fórmula I, Ia ou Ib, em que o radical piridila é um radical pirid-3-ila.

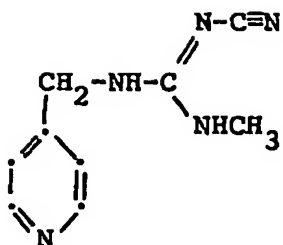
5. - Emprego segundo a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de ser do composto da fórmula



6. - Emprego segundo a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de ser do composto da fórmula



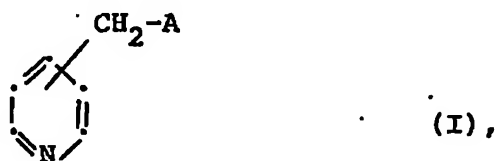
7. - Emprego segundo a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de ser do composto da fórmula



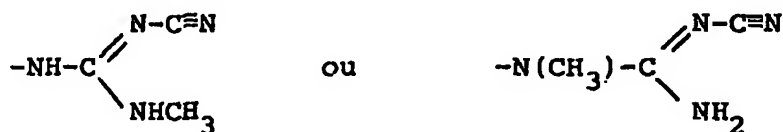
8. - Emprego segundo uma das reivindicações 1 a 7, caracterizado pelo fato de ser para o combate de insetos prejudiciais às plantas.

9. - Emprego segundo a reivindicação 6, caracterizado pelo fato de ser para o combate de insetos, especialmente de cigarras, em culturas de arroz.

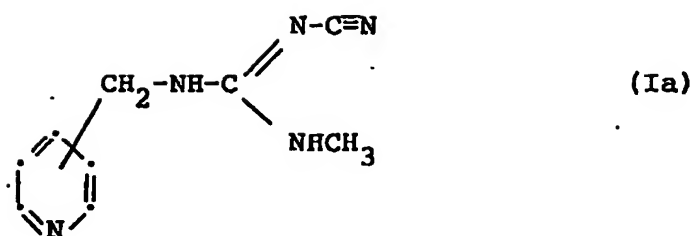
10. - Composição para o combate de insetos prejudiciais e pragas da ordem acarina, caracterizada pelo fato de conter, como componente ativo, pelo menos um composto da fórmula I ou seus tautômeros



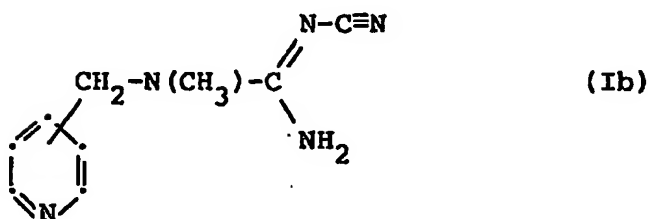
em que A é um radical



11. - Composição segundo a reivindicação 10, caracterizada pelo fato de conter um composto da fórmula Ia

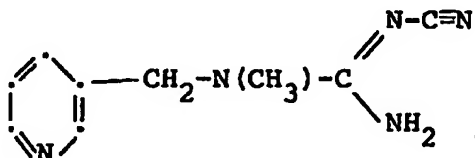


12. - Composição segundo a reivindicação 10,  
caracterizada pelo fato de conter um composto da fórmula  
Ib

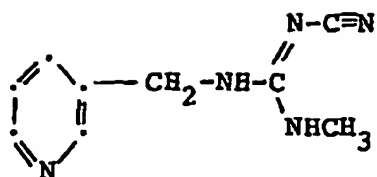


13. - Composição segundo uma das reivindicações  
5 10 a 12, caracterizada pelo fato de conter um composto  
da fórmula I, Ia ou Ib, em que o radical piridila é um  
radical pirid-3-ila.

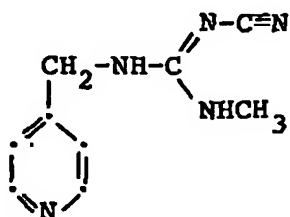
14. - Composição segundo a reivindicação 13,  
caracterizada pelo fato de conter o composto da fórmula



10 15. - Composição segundo a reivindicação 13,  
caracterizada pelo fato de conter o composto da fórmula



16. - Composição segundo a reivindicação 13, caracterizada pelo fato de conter o composto da fórmula



17. - Processo para o combate de insetos e representantes da ordem acarina, caracterizado pelo fato de se pôr em contato ou se tratar as pragas ou seus diversos estágios de desenvolvimento ou seu local de existência, com uma quantidade de eficiência pesticida de um composto da fórmula I segundo uma das reivindicações 1 a 7 ou com uma composição segundo uma das reivindicações 10 a 16, que contém além de aditivos e veículos, uma quantidade de eficiência pesticida desse composto.

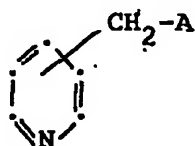
300301

# R E S U M O

Patente de Invenção: "EMPREGO DE UM COMPOSTO, COMPOSIÇÃO E PROCESSO PARA O COMBATE DE INSETOS".

Emprego de compostos da fórmula I e seus tautô

5 meros



(I),

em que A é um radical



para o combate de insetos prejudiciais e pragas da ordem acarina, bem como composição contendo esses compostos. Es  
ses compostos se prestam especialmente para o combate de  
10 insetos prejudiciais devoradores e sugadores.